# 证明

### 本证明之附件是向本局提交的下列专利申请副本

REC'D 0 1 DEC 2004

WIPO PCT

申 请 日:

2003.09.26

申 请

03146951.5

申请类别:

发明

发明创造名称:

复方青蒿素

申 请 人: 李国桥

号:



李国桥、宋建平

#### PRIORITY DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

中华人民共和国 国家知识产权局局长



2004年10月22日

1. 一种复方青蒿素,其特征在于用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉,复方包括以下成份:青蒿素 (Artemisinin)、哌喹 (Piperaquine)、伯氨喹 (Primaquine),三药的配伍比例范围是:

青蒿素 (Artemisinin)

1 份

哌喹 (Piperaquine)

3—9 份

伯氨喹 (Primaquine)

0-0.2 份

三药的最佳配比是1:6:0.6。

2. 根据权利要求 1 所述的复方青蒿素, 其特征在于所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。



#### 复方青蒿素

所属技术领域

本发明涉及治疗疟疾的药物,特别是具有高效速效疗效的复方青蒿素。

背景技术

现有技术中的治疟药物有的采用青蒿素衍生物(如双氢青蒿素、青蒿琥酯、蒿甲醚、蒿乙醚)与长半衰期的哌喹配伍,使得疗程长,容易使疟原虫产生抗药性;有的用哌喹和伯氨喹的磷酸盐,由于其磷酸盐对胃肠道有副作用,故疗效欠佳。现有技术的治疟药物还存在生产工艺长,成本高,药物稳定保质期短,服用量大等缺点。

发明内容

本发明的目的旨在克服现有技术的不足而提供一种具有疗程短,副作用更小,原料成本更低、服用更方便、有高效速效的复方青蒿素。

本发明的目的是这样实现的:

一种复方青蒿素,用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉,复方包括以下成份:青蒿素(Artemisinin)、哌喹(Piperaquine)、伯氨喹(Primaquine),三药的配伍比例范围是:

青蒿素 (Artemisinin)

1 份

哌喹 (Piperaquine)

3---9 份

伯氨喹 (Primaquine)

0-0.2 份

三药的最佳配比是1:6:0.6。

——所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。

本发明通 600 多例临床试验,对多重抗药性恶性疟、间日疟和三日疟证明本药具有速效、高效、低毒、短疗程、快速清除传染源以阻断疟疾传播的特点,其疗效、功能明显优于目前国内外的同类药。

具体实施方式

按下述配方取量:

青蒿素 (Artemisinin)

120g

哌喹 (Piperaguine)

1200g

伯氨喹(Primaquine)

6g

辅料(羟丙基纤维素等)

适量

制成

1000 片

制剂工艺:

将合格的原料分别粉碎,过100目筛,然后按处方量准确取原料及辅料,将各组分混合均匀压片或作成各种儿童剂型,包装即成为成品。

本发明复方青蒿素用于治疗各类疟疾(恶性疟、间日疟、三日疟等人类疟疾),尤 其是多重抗药性恶性疟,成人总剂量为2片,每天服1片。

## 说 明 书

本复方中的伯氨喹含量每片仅含 6mg,即一天用量,仅用 2 天,此剂量是比常规用量 3 天 67.5mg 减少了 82%,与青蒿素配合应用,经实验研究证明可使恶性疟原虫配子体在首剂服药后 24 小时即完全失去感染性,从而阻断其传播,又无任何副作用。这是该复方使用超低剂量伯氨喹的一大特点。

由于本复方比任何青蒿素类复方的主要原料的成本更低,体积更小,疗程更短,服用更方便(成人2天2片),且具有明显杀灭配子体阻断疟疾传播的作用,因而有利于该复方以较低的价格进入发展中国家公立医院,更有利于全球抗疟措施的推广应用。